

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 8 月 25 日 (25.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/077953 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 487/04, A61K  
31/5025, 31/53, A61P 1/16, 3/00, 3/04, 3/06, 3/10, 5/00,  
9/00, 9/04, 9/10, 9/12, 13/12, 19/06, 25/00, 25/02, 25/08,  
25/14, 25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/32, 27/00,  
39/02, 43/00, C07D 487/14

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002948

(22) 国際出願日: 2005 年 2 月 17 日 (17.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-042171 2004 年 2 月 18 日 (18.02.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO., LTD.)  
[JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町 2 丁目  
2 番 3 号 Tokyo (JP).

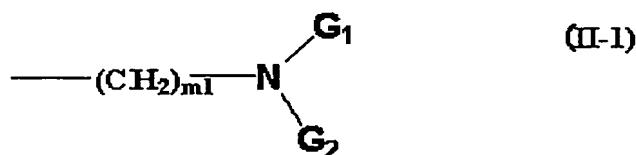
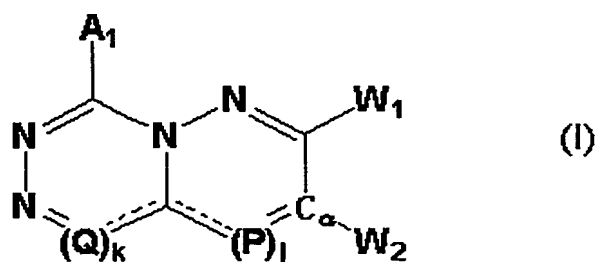
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 高橋 敏行 (TAKA-  
HASHI, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市  
大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki  
(JP). 金谷 章生 (KANATANI, Akio) [JP/JP]; 〒3002611茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つ  
くば研究所内 Ibaraki (JP). 鍋田 滋 (TOKITA, Shigeru)  
[JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬  
有製薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP). 善本 亮  
(YOSHIMOTO, Ryo) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば  
市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つくば研究所内  
Ibaraki (JP).(74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHAR-  
MACEUTICAL CO., LTD.); 〒1038416 東京都中央区  
日本橋本町 2 丁目 2 番 3 号 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,

[続葉有]

(54) Title: NITROGENOUS FUSED HETEROAROMATIC RING DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 含窒素縮合ヘテロ芳香環誘導体



(57) Abstract: A compound represented by the formula (I): [wherein A<sub>1</sub> represents hydrogen, etc.; j and k each is 0 or 1; ... (P)<sub>j</sub> = represents a double bond, etc.; ... (Q)<sub>k</sub> = represents a double bond, etc.; and one of W<sub>1</sub> and W<sub>2</sub> represents E-O-W, etc. and the other represents hydrogen, etc., provided that E represents a divalent group formed by removing two hydrogen atoms from a benzene ring, etc. and W represents a group represented by the formula (II-1)] or a pharmaceutically acceptable salt of the compound. The compound and salt have antagonistic activity against a histamine H<sub>3</sub> receptor or inverse agonistic activity against a histamine H<sub>3</sub> receptor and are useful in the prevention or treatment of metabolic diseases, circulatory diseases, or nervous diseases.

[続葉有]

WO 2005/077953 A1



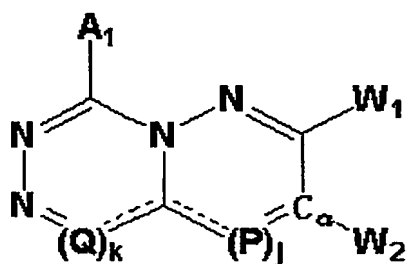
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

(57) 要約:

本発明は、ヒスタミンH<sub>3</sub>受容体拮抗作用又はヒスタミンH<sub>3</sub>受容体逆作動作用を有し、代謝系疾患、循環器系疾患又は神経系疾患の予防又は治療に有用である式 (I)



(I)

[式中、A<sub>1</sub>は水素原子等を示し、j、kは、0又は1を示し、

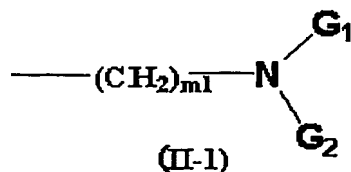
====(P)<sub>j</sub>====

は、二重結合等を示し、

====(Q)<sub>k</sub>====

は、二重結合等を示し、

W<sub>1</sub>及びW<sub>2</sub>は、一方がE—O—W等を示し、他方が水素原子等を示し、Eは、ベンゼン環等から2つの水素原子を除いてなる2価の基を示し、Wは、式 (I-1)



(II-1)

で表される基を示す] で表される化合物、又はその薬学的に許容される塩を提供する。